

## TRATADO DE COOPERACIÓN EN MATERIA DE PATENTES

## PCT

REC'D 16 NOV 2005

INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE PATENTABILIDAD  
(Capítulo II del Tratado de Cooperación en materia de Patentes)

WIPO

PCT

(Artículo 36 y Regla 70 del PCT)

|  |   |  |                               |
|--|---|--|-------------------------------|
| Referencia del expediente del solicitante o del mandatario   | <b>PARA CONTINUAR LA TRAMITACIÓN</b>  |  | Véase formulario PCT/IPEA/416 |
| Solicitud internacional N°<br><b>PCT/ES2004/000361</b>   | Fecha de presentación internacional<br>(día/mes/año)<br><b>(04.08.2004)</b> | Fecha de prioridad (día/mes/año)<br><b>04 AGOSTO 2003</b><br><b>(04.08.2003)</b> |                               |
| Clasificación Internacional de Patentes (IPC) o a la vez clasificación nacional e IPC<br><b>A61K31/675, 31/185, 31/53, A61P25/28</b> |   |  |                               |
| Solicitante<br><b>UNIVERSIDAD DEL PAIS VASCO - EUSKAL HERRIKO UNIBERTSITATEA, MATEU ALMAU, Carlos y otros</b>                        |   |  |                               |

- El presente informe preliminar internacional sobre patentabilidad, se establece por esta Administración encargada del examen preliminar internacional según el Artículo 35 y se transmite al solicitante conforme al Artículo 36.
- Este INFORME comprende 4 hojas, incluida la presente hoja de portada.
- Este informe también contiene ANEXOS, que comprenden:
  - ☒ (remitido al solicitante y a la Oficina Internacional) un total de 1 hojas. descritas a continuación:
    - ☒ hojas de la descripción, las reivindicaciones y/o los dibujos que han sido modificadas y que sirven de base al presente informe, y/o de hojas que contienen rectificaciones autorizadas por esta Administración (véase la Regla 70.16 y la Instrucción Administrativa 607 del PCT).
    - ☐ hojas que reemplazan a otras hojas anteriores, pero que esta Administración considera que contienen modificaciones que se extienden más allá de la divulgación de la invención tal como fue originalmente presentada, según se indica en el punto 4 del Recuadro I y en el Recuadro Suplementario.
  - ☐ (remitido únicamente a la Oficina Internacional) un total de (indicar tipo y número de soporte(s) electrónico(s)) \_\_\_\_\_, que contiene una lista de secuencias y/o tabla(s) relativas(s), solo en formato electrónico, como se indica en el Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias (ver Instrucción Administrativa 802).
- El presente informe contiene indicaciones relativas a los puntos siguientes:
  - ☒ Recuadro I Base de este informe
  - ☐ Recuadro II Prioridad
  - ☐ Recuadro III No formulación de opinión sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial
  - ☐ Recuadro IV Falta de unidad de invención
  - ☒ Recuadro V Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración
  - ☐ Recuadro VI Ciertos documentos citados
  - ☐ Recuadro VII Defectos en la solicitud internacional
  - ☐ Recuadro VIII Observaciones relativas a la solicitud internacional

|  |  |
|--|--|
| Fecha de presentación de la solicitud de examen preliminar internacional<br><b>10 MAYO 2005 (10.05.2005)</b>   | Fecha de finalización del presente informe<br><b>20 OCTUBRE 2005 (20.10.2005)</b>          |
| Nombre y dirección postal de la Administración encargada del examen preliminar internacional<br><b>OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS</b><br><b>C/ Panamá, 1 - 28071 Madrid (España)</b><br>N° de fax: 91 349 53 04 | Funcionario autorizado<br><b>Aylagas Cancio, Hortensia</b><br>N° de teléfono: 91 349 54 75 |

Formulario PCT/IPEA/409 (hoja de portada) (Abril 2005)

BEST AVAILABLE COPY

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE  
PATENTABILIDAD**

Solicitud internacional N°

**PCT/ES2004/000361**

**Recuadro I. Base de este informe**

1. Por lo que respecta al idioma, este informe se ha establecido sobre la base de la solicitud internacional en el idioma en el cual se depositó, salvo indicación en contra señalada a continuación.

- ☐ Este informe está basada en una traducción del idioma original al siguiente idioma \_\_\_\_\_, que es el de una traducción proporcionada a los fines de:
- ☐ búsqueda internacional (según Reglas 12.3 y 23.1.b))
  - ☐ publicación de la solicitud internacional (según Regla 12.4)
  - ☐ examen preliminar internacional (según Reglas 55.2 y/o 55.3)

2. Por lo que respecta a los elementos de la solicitud internacional, esta opinión se ha establecido sobre la base de *(las hojas de reemplazo que hayan sido enviadas a la Oficina receptora en respuesta a un requerimiento según el artículo 14 se las denomina en este informe como "inicialmente presentadas" y no se anexan al informe)*:

- ☐ la solicitud internacional tal y como fue inicialmente presentada/enviada

- ☒ la descripción:

páginas 1-23, tal como se presentaron/enviaron inicialmente

páginas \* \_\_\_\_\_ recibidas por esta Administración en fecha \_\_\_\_\_

páginas \* \_\_\_\_\_ recibidas por esta Administración en fecha \_\_\_\_\_

- ☒ las reivindicaciones:

páginas \_\_\_\_\_, tal como se presentaron/enviaron inicialmente

páginas \* \_\_\_\_\_, modificadas (acompañadas de una declaración) según el artículo 19

páginas \* 24 recibidas por esta Administración en fecha 26/09/2005

páginas \* \_\_\_\_\_ recibidas por esta Administración en fecha \_\_\_\_\_

- ☒ los dibujos:

páginas 1-9, tal como se presentaron/enviaron inicialmente

páginas \* \_\_\_\_\_ recibidas por esta Administración en fecha \_\_\_\_\_

páginas \* \_\_\_\_\_ recibidas por esta Administración en fecha \_\_\_\_\_

- ☐ una lista de secuencias y/o tabla(s) relativa(s) - ver Recuadro Suplementario relativo a Listas de Secuencias

3. ☐ Las modificaciones ha ocasionado la anulación de:

☐ la descripción, páginas \_\_\_\_\_

☐ las reivindicaciones, N°s \_\_\_\_\_

☐ los dibujos, hojas/fig. \_\_\_\_\_

☐ la lista de secuencias (*precisar*) \_\_\_\_\_

☐ tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (*precisar*) \_\_\_\_\_

4. ☐ El presente informe ha sido establecido como si no se hubiesen presentado (algunas de) las modificaciones anexadas a este informe y listadas abajo, ya que se ha considerado que iban más allá de la divulgación de la invención tal como fue presentada, como se indica en el Recuadro Suplementario (Regla 70.2.c)).

☐ la descripción, páginas \_\_\_\_\_

☐ las reivindicaciones, N°s \_\_\_\_\_

☐ los dibujos, hojas/fig. \_\_\_\_\_

☐ la lista de secuencias (*precisar*) \_\_\_\_\_

☐ tabla(s) relativa(s) a la lista de secuencias (*precisar*) \_\_\_\_\_

\* Si se utiliza el punto 4, algunas o todas estas páginas pueden llevar el sello de "sustituida"

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE  
PATENTABILIDAD**

Solicitud internacional N°

**PCT/ES2004/000361**

**Recuadro V. Declaración motivada según el Artículo 35.2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración**

**1. Declaración**

|                       |                  |            |    |
|-----------------------|------------------|------------|----|
| Novedad               | Reivindicaciones |            | Sí |
|                       | Reivindicaciones | 1, 2, 5, 6 | NO |
| Actividad inventiva   | Reivindicaciones |            | Sí |
|                       | Reivindicaciones | 1, 2, 5, 6 | NO |
| Aplicación industrial | Reivindicaciones | 1-6        | Sí |
|                       | Reivindicaciones |            | NO |

**2. Citas y explicaciones (Regla 70.7)**

**Documentos tenidos en consideración.**

| Doc. | Número Publicación o Identificación                         | Fecha Pub. |
|------|---|------------|
| D01  | WO 9938532 A  | 05.08.1999 |
| D02  | British Journal of Pharmacology, vol. 120, páginas 954-960. | 1997       |
| D03  | Journal of Neurosurgery, vol 07, páginas 129-135.           | 2002       |
| D04  | Pain, vol. 96, páginas 99-105                               | 2002       |
| D05  | Pain, vol. 96, páginas 99-105                               | 2000       |
| D06  | WO 9803178 A  | 29.01.1998 |
| D07  | EP 1310493 A  | 14.05.2003 |
| D08  | WO 03047515 A   | 12.06.2003 |

La presente invención se refiere a antagonistas de un receptor purinérgico P2X7, seleccionados de entre Evans Blue, NF279, BBG, o-ATP, KN62, TNP-ATP o HMA, las composiciones farmacéuticas que lo contienen y su uso para el tratamiento de enfermedades desmielinizantes y autoinmunes, preferiblemente de la esclerosis múltiple

Los documentos D1 a D5 se refieren a diferentes antagonistas de receptores purinérgicos tales como NF23, suramin, Evans Blue, Trypan blue, DIDS, PPADS y TNP-ATP con aplicaciones farmacológicas tales como prevención de la fibrosis y de la esclerosis, antagonización de las respuestas vasoconstrictoras, reversión del vasospasmo, reducción del dolor abdominal y regulación de la alodinia. El documento D6 se refiere al uso de antagonistas del receptor P2Y en particular P2Y1, tales como suramina, PPADS Y DIDS, en el tratamiento de enfermedades desmielinizantes entre las que se cita la esclerosis múltiple. Los documentos D7 y D8 se refieren a compuestos con actividad como antagonistas de los receptores purinérgicos P2X7 y su aplicación en el tratamiento de enfermedades autoinmunes, inflamatorias o degenerativas. Los compuestos mencionados son derivados del adamantano y derivados de L-tirosina.

Las reivindicaciones 1, 2, 5 y 6 se refieren a productos (compuestos o composiciones) definidos en términos de su mecanismo de acción y de su aplicación terapéutica. Esta mención del uso de los productos se considera meramente descriptiva y, por tanto, una característica técnica no limitante a la hora de analizar la novedad de dichas reivindicaciones. Dado que los compuestos recogidos en las reivindicaciones 1 y 2 son conocidos en el estado de la técnica y para los que se ha divulgado ya su actividad como antagonistas de los receptores P2X, no es posible reconocer novedad ni actividad inventiva para las reivindicaciones de producto antes mencionadas (Art. 33 (2) y (3) PCT

Continúa en página siguiente...

**INFORME PRELIMINAR INTERNACIONAL SOBRE  
PATENTABILIDAD**

Solicitud internacional N°

**PCT/ES2004/000361**

**Continuación Recuadro V. Declaración motivada según el Artículo 35(2) sobre la novedad, la actividad inventiva y la aplicación industrial; citas y explicaciones en apoyo de esta declaración**

En cuanto a las reivindicaciones 3 y 4 relativas al uso de estos productos, ninguno de los documentos citados revela el empleo de estos productos en el tratamiento de enfermedades desmielinizantes y autoinmunes, preferiblemente en la esclerosis múltiple, por lo que se considera que la materia de las reivindicaciones 3 y 4 es nueva y con actividad inventiva de acuerdo con los artículos 33 (2) y (3) PCT.

Sigue en página siguiente...

**REIVINDICACIONES**

- 5 1. Antagonista de un receptor purinérgico P2X7 para el tratamiento de enfermedades desmielinizantes y autoinmunes, preferiblemente de la esclerosis múltiple, en mamíferos incluido el hombre, caracterizado porque dicho antagonista se selecciona de entre Evans Blue, NF279, BBG, o-ATP, KN62, TNP-ATP o HMA.
- 10 2. Antagonista de un receptor purinérgico P2X7 para el tratamiento de las enfermedades desmielinizantes y autoinmunes, de acuerdo con la reivindicación 1, caracterizado porque el antagonista es el o-ATP.
- 15 3. Empleo de un antagonista de los receptores purinérgicos P2X7, en la elaboración de un medicamento para el tratamiento de enfermedades desmielinizantes y autoinmunes, preferiblemente de la esclerosis múltiple, en mamíferos incluido el hombre, caracterizado porque dicho antagonista se selecciona de entre Evans Blue, NF279, BBG, o-ATP, KN62, TNP-ATP o HMA.
- 20 4. Empleo de un antagonista de los receptores purinérgicos P2X7, de acuerdo con la reivindicación 3, caracterizado porque dicho antagonista es el o-ATP.
- 25 5. Composición farmacéutica que comprende al menos un antagonista de un receptor purinérgico P2X7 y al menos un excipiente farmacéuticamente aceptable caracterizado porque dicho antagonista se selecciona de entre Evans Blue, NF279, BBG, o-ATP, KN62, TNP-ATP o HMA.
6. Composición farmacéutica, de acuerdo con la reivindicación 5, caracterizada porque el antagonista es el o-ATP.